

001353113

WPI Acc No: 1975-02733W/197502

Thiazol benzimidazole derivs prepn. - by reacting
2-mercaptobenzimidazoles with acid anhydrides

Patent Assignee: YOSHITOMI PHARM IND KK (YOSH)

Number of Countries: 001 Number of Patents: 002

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 49095997	A	19740911				197502 B
JP 80044755	B	19801113				198050

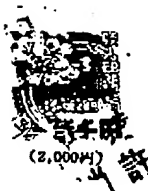
Priority Applications (No Type Date): JP 7310463 A 19730124

Abstract (Basic): JP 49095997 A

Plant growth regulating thiazolobenzimidazole derivs. (I; R₁, R₂ = H, halo, lower alkyl, lower alkoxy; A = CH=CH, CHR₃CH₂ (R₃ = active groups) are prepd. by reacting 2-mercaptobenzimidazoles (22) with acid anhydrides (III) In an example refluxing 30 g 2-mercaptobenzimidazole with 19.5 g maleic anhydride in dioxane 24 hr. gave 29.1 g I (R₁ = R₂ = H). Also the following I were prepd. (R₁, R₂ given) : 6 (or 7) - Cl, H; MeO, and 6 (or 7) - Me, H.

Derwent Class: C02

International Patent Class (Additional): A01N-043/90; C07D-513/04



13

⑬ 日本国特許庁
公開特許公報

特 許 願 (2) (後記号ナシ)
昭和 48 年 1 月 24 日

特許庁長官 三 宅 幸 次 殿

1. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 発明者

住 所 大阪府大阪市平野区 3丁目35番地
氏 名 吉富製薬株式会社
代表者 不破 泰 (2) 1 頁

3. 特許出願人

住 所 大阪府大阪市平野区 3丁目35番地
氏 名 吉富製薬株式会社
代表者 不破 泰

4. 代理人 甲 541

住 所 大阪府大阪市平野区 3丁目35番地
氏 名 弁護士(6630) 高宮 誠

5. 添付書類の目録

- (1) 明 細 書 1 通
- (2) 要 任 状 1 通
- (3) 特許願副本 1 通

①特開昭 49 - 95997
④公開日 昭49.(1974) 9. 11
②特願昭 48 - 10463
②出願日 昭48.(1973) 1. 24
審査請求 未請求 (全4頁)

庁内整理番号

6736 44	16 E621
6647 49	30 F371.222
7167 49	30 F932

⑤日本分類

明 細 書

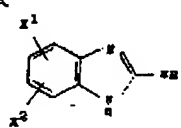
1. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

2. 発明の要旨

2. 特許願本の範囲

一般式

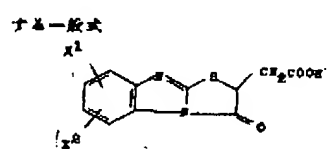


で表わされる2-メルカプトベンズイミダゾール

化合物と一般式



で表わされる酸無水物を反応させることを特徴とする一般式



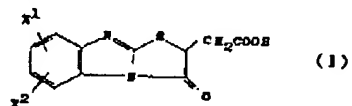
で表わされるチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法。

上記式中 X^1 , X^2 はそれぞれ水素、ハロゲン、

低級アルキルまたは低級アルコキシをなし、 X^1 は $-CH=CH-$ または $-CH_2-CH_2-$ を示し、ここで X^1 は活性基である。

1. 発明の要旨を説明

本発明は一般式

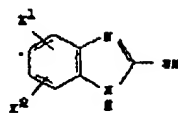


(式中 X^1 , X^2 はそれぞれ水素、ハロゲン(フッ素、塩素、臭素、ヨウ素)、低級アルキル(メチル、エチルなど)または低級アルコキシ(メトキシ、エトキシなど)を示す。)

で表わされる新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法に関する。

本発明方法によれば、一般式(I)の化合物は、

一般式



(II)

(式中 R^1 , R^2 は前述のとおり)

て表わされる1-ノルカプトベンズイミダゾール化合物と一般式



(III)

(式中 A は $-CH=CH-$ または $-CH_2-CH_2-$ を示し、

ここで Y は水素、メチル、エチル、オキシ、

フェニル、スルホニルなどの活性基を示す。)

て表わされる炭素化合物を反応させることにより製造される。

反応は無触媒あるいは不活性触媒(ジオキサン、

テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エタレ

ングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリ

コールジメチルエーテル等のエーテル類、ジメチ

ルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサ

メチルホルムアミド等のアミド類、アセトン、

メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、

シクロヘキサノン等のケトン類、酢酸エチル、酢

酸プロパル等のエステル類、ギ酸、酢酸、酪酸等の

カルボン酸類、リン酸、ポリリン酸、ベンゼン、

トルエン、キレレン、クノン、リグロイン等の炭

化水素類、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロル

エタン等のハロゲン化炭化水素類等またはこれら

の混合物中)で行なわれる。

反応に際しては、ナトリウムメチラート、カリウ

ムエチラート、活性ソーダ、活性カリ、炭酸カリ、

炭酸ソーダ、重炭酸カリ、重炭酸ソーダ、重炭酸

カルシウム、トリメチルアミン、ピリジン、キノ

リン、N-メチルモルホリン等の脱酸剤を用いて

もよく、またノルカプトベンズイミダゾールをあら

かじめ金属塩(ソーダ塩、カリウム塩、リチウ

ム塩、銀塩、銅塩等)として、反応に供してもよい。

反応温度は室温から150℃付近で、反応時

間は数時間から数十時間程度である。

得られる化合物は必要に応じて、ナトリウム、カ

リウム、銀、銅、カルシウム、バリウム、トリメ

チルアミン、ピリジン、キノリン等との有機塩、

無機塩として単離精製しても良い。

かくして得られる化合物(I)は植物生長調節

作用を有し、農薬として有用である。

以下に実施例を示して、本発明を具体的に説明

するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

実施例1

1-カルボキシメチル-2-オキソ-2,3-

ジヒドロ-4アゾロ(1,2-エ)ベンズイミダ

ゾールの製造

方法1

1-ノルカプトベンズイミダゾール30g、無

水マレイン酸15.0gをジオキサン100ccに加

え、24時間煮沸した。反応液を室温に冷却する

と、黄色結晶25.0gを得た。母液を水1:4に注

ぐと、さらに15.0gの結晶を得た。両結晶を合

せ、再度より再結晶すると、融点207~209

℃(分解)〔濃褐色の固体に変化)を示す炭酸化

合物25.1gを黄色結晶性粉末として得た。

方法2

1-ノルカプトベンズイミダゾール10.0gを

ジメチルホルムアミド200ccに溶解し、かくは

んに、無水マレイン酸5.0gを含むジメチルホ

ルムアミド溶液 10 ml を 2 時間静置して固下し、
40 時間かくはんした。炭青色透明の反応液を濃
縮し、得られた褐色結晶を溶媒より分別結晶する
と、原料 2-ノルカプトベンズイミダゾール 4.0
g と炭素化合物 2.2 g を得た。

方法 1

2-ノルカプトベンズイミダゾール 1.4 g、2-
ブロマロハク酸無水物 1.4 g、炭酸カリ 2.9 g
をジオキサン 100 ml に加え、60 時間かくはん
反応した。熱時不溶物を除去し、溶液を室温まで
冷却した後、水 1 ml に注ぎ、析出する結晶を溶媒
から再結晶すると、炭素化合物 1.6 g を得た。

方法 2

2-ノルカプトベンズイミダゾール 2.0 g、無
水マレイン酸 2.0 g をよく混和し、封管中で 12
0-140°C に 6 時間保った。得られた固形物を

特開 昭 49-95997 (3)
特許から再結晶すると、炭素化合物 1.3 g を得た。

前記実施例と同様な方法により、次の化合物が
製造される。

⑤ 2-カルボキシルノタル-6-（または 7-）
クロロ-3-オキソ-2, 3-ジヒドロチアゾ
ロ〔3, 2-a〕ベンズイミダゾール、融点 17
6-178°C（分解）

⑥ 2-カルボキシルノタル-6, 7-ジノトケレ
-3-オキソ-2, 3-ジヒドロチアゾロ〔3
, 2-a〕ベンズイミダゾール、融点 220°C 以
上

⑦ 2-カルボキシルノタル-6-（または 7-）
ノタル-3-オキソ-2, 3-ジヒドロチアゾ
ロ〔3, 2-a〕ベンズイミダゾール。

代理人 弁護士 高宮城 勝

6. 前記以外の発明者

住 所 大阪府大阪市 1-3-45（無職者）
氏 名 小 谷 勇 一 郎

手 続 補 正 書

昭和 48 年 4 月 18 日

特許庁長官 三宅 幸夫 殿

1. 事件の表示

昭和 48 年特許願第 10463 号

2. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

3. 補正をする者

事件との関係	特許出願人
住 所	大阪府大阪市平野区 3 丁目 85 番地
名 称	吉富製薬株式会社
代 理 人	代 理 人 不 破 泰

4. 代 理 人

住 所	大阪府大阪市平野区 3 丁目 85 番地
名 称	吉富製薬株式会社内
氏 名	弁護士 高宮城 勝 (6690)

5. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

6. 補正の内容

特許 昭49-95997(4)

明細書第1頁14行目の「ベンズイミダゾール」
、」の次に「融点173～175℃(分解)」を
挿入する。

以 上

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

☐ BLACK BORDERS

☒ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

☐ FADED TEXT OR DRAWING

☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

☒ SKEWED/SLANTED IMAGES

☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

☐ GRAY SCALE DOCUMENTS

☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.